

⑨ BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENTAMT

⑫ Offenlegungsschrift
⑪ DE 30 42 303 A 1

⑤① Int. Cl. 3:
C 07 D 233/60

②① Aktenzeichen:
②② Anmeldetag:
②③ Offenlegungstag:

P 30 42 303.1
8. 11. 80
27. 8. 81

②④ Unionspriorität: ②⑤ ②⑥ ②⑦

13.11.79 US 93800

18.07.80 US 170982

②⑧ Erfinder:

Spencer, Homer Kenneth, 07889 Randolph, N.J., US

②⑨ Anmelder:

Sandoz-Patent-GmbH, 7850 Lörrach, DE

DE 30 42 303 A 1

⑤④ Organische Verbindungen, deren Herstellung und Verwendung

DE 30 42 303 A 1

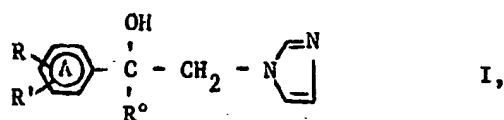
27

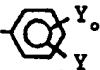

SANDOZ-PATENT-GMBH

Case 136-6877

7850 LörrachOrganische Verbindungen, deren Herstellung und VerwendungP a t e n t a n s p r ü c h e

1. Verbindungen der Formel



- worin R^o einen Alkylrest mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, einen Cycloalkylrest mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, einen Cycloalkylalkylrest, in welchem der Cycloalkylrest 3 bis 6 C-Atome und der Alkylteil 1 bis 3 C-Atome enthält, der Cycloalkylrest und/oder der Cycloalkylalkylrest gegebenenfalls durch einen oder zwei Alkylreste, mit 1 bis 3 C-Atomen, substituiert sein kann,
- R Wasserstoff, Halogen mit einer Atomnummer von 9 bis 35, einen Alkylrest mit 1 bis 4 C-Atomen, einen Alkoxyrest mit 1 bis 4 C-Atomen, einen Alkylthioest mit 1 bis 4 C-Atomen oder Nitro und
- R' Wasserstoff, Halogen mit einer Atomnummer von 9 bis 35, einen Alkylrest mit 1 bis 4 C-Atomen, einen Alkoxyrest mit 1 bis 4 C-Atomen, einen Alkylthioest mit 1 bis 4 C-Atomen, -CF₃ in 3-Stellung des Ringes A, Nitro, -CN, -COOR'', einen gegebenenfalls substituierten Phenylrest der Formel  oder einen gegebenenfalls substituierten Phenoxyrest in 4-Stellung des Ringes A der Formel -O-,
- R'' Wasserstoff oder einen Alkylrest mit 1 bis 4 C-Atomen bedeuten,
- R und R' zusammen einen, ein oder zwei C-Atome enthaltenden, Alkylendioxyrest, welcher an zwei benachbarten C-Atomen des Phenylringes A substituiert ist und

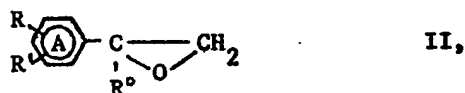
Y_o und Y unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen mit einer Atomnummer von 9 bis 35, einen Alkylrest mit 1 bis 4 C-Atomen oder einen Alkoxyrest mit 1 bis 4 C-Atomen bedeuten,

mit der Massgabe, falls R_o für n-Butyl steht:

- a) wenigstens einer der Reste R und R' verschieden von Wasserstoff ist, und
- b) R oder R' nicht für Halogen stehen.

2. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäss Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

- a) eine Verbindung der Formel

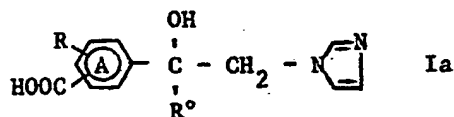


worin R^o , R und R' die zuvor angegebenen Bedeutungen besitzen, mit einer Verbindung der Formel



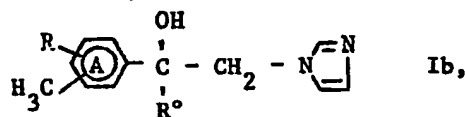
worin X ein Alkalimetallatom bedeutet, in einem organischen Lösungsmittel umgesetzt,

- b) um Verbindungen der Formel



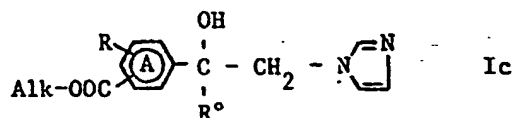
zu erhalten,

worin R^o und R die zuvor genannten Bedeutungen besitzen, die CH_3 -Gruppe in einer Verbindung der Formel



worin R^o und R die zuvor genannten Bedeutungen besitzen, oxydiert oder

c) um eine Verbindung der Formel



zu erhalten,

worin R und R° die zuvor angegebenen Bedeutungen besitzen,

eine Verbindung der Formel Ia mit einem Alkohol der Formel

Alk - OH

IV,

oder einem funktionellen Derivat dieser Verbindung, worin Alk die

zuvor angegebenen Bedeutungen besitzt, verestert.

3. Verfahren zur Bekämpfung von Fungi, insbesondere phytopathogenen Fungi in Pflanzen, Saatgut, Samen oder im Boden, dadurch gekennzeichnet, dass man diese Pflanzen, das Saatgut, die Samen oder den Boden mit einer einen nicht-phytotoxisch fungiciden Effekt aufweisenden Mengen einer Verbindung der Formel I in freier Form oder in einer für die Landwirtschaft verträglichen Salzform behandelt.
4. Fungicide Zusammensetzung, enthaltend eine Verbindung der Formel I gemäss Anspruch 1 in freier Form oder in einer für die Landwirtschaft verträglichen Salzform in Verbindung mit einem fungiciden Carrier oder einem Verdünner.
5. Mittel zur Bekämpfung von Fungi, insbesondere von phytopathogenen Fungi, enthaltend eine Verbindung der Formel I gemäss Anspruch 1 als Aktivsubstanz.
6. Verbindungen gemäss Anspruch 1, worin R für Wasserstoff, Halogen mit einer Atomnummer von 9 bis 35 oder (1-4C)-Alkyl und R' für Wasserstoff, Halogen mit einer Atomnummer von 9 bis 35, für (1-4C)-Alkyl, (1-4C)-Alkoxy, oder für eine Gruppe der Formel $\text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \begin{array}{c} \text{Y} \\ | \\ \text{---} \end{array}$ oder $\text{---} \text{O} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \begin{array}{c} \text{Y} \\ | \\ \text{---} \end{array}$, welche in para-Stellung im Ring A gebunden ist, steht.
7. Verbindungen der Formel I gemäss Ansprüchen 1 und 6, worin R für Wasserstoff, Fluor oder Chlor und R' für Wasserstoff, Halogen mit einer Atomnummer von 9 bis 35, für (1-2C)-Alkyl oder (1-2C)-Alkoxy oder für para-Phenoxy steht.

00-11-80

3042303

- 4 -

Case 136-6877

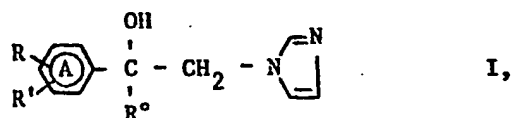
8. Verbindungen der Formel I gemäss Ansprüchen 1, 6 und 7, worin R° für einen Alkylrest mit 3 bis 6 C-Atomen oder für Cycloalkyl mit 3 bis 6 C-Atomen steht.
9. Verbindungen der Formel I gemäss Ansprüchen 1, 6, 7 und 8, worin R° für einen verzweigten Butylrest, für Cyclopropyl oder Cyclopentyl steht.
10. Verbindung α -tert.-Butyl- α -(para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-Äthanol gemäss Anspruch 1.

130035/0359

Organische Verbindungen, deren Herstellung und Verwendung

Gegenstand der Erfindung sind α -Aryl-1H-imidazol-1-äthanole, insbesondere α -Alkyl oder Cycloalkyl- α -phenyl-1H-imidazol-1-äthanole, ihre Verwendung als Fungicide und in Zusammensetzungen mit denen sie den Gebrauch für die Landwirtschaft vereinfachen.

Ganz besonders beinhaltet die Erfindung Verbindungen der Formel



- worin R^o einen Alkylrest mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, einen Cycloalkylrest mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, einen Cycloalkylalkylrest, in welchem der Cycloalkylrest 3 bis 6 C-Atome und der Alkylteil 1 bis 3 C-Atome enthält, der Cycloalkylrest und/oder der Cycloalkylalkylrest gegebenenfalls durch einen oder zwei Alkylreste, mit 1 bis 3 C-Atomen, substituiert sein kann,
- R Wasserstoff, Halogen mit einer Atomnummer von 9 bis 35, einen Alkylrest mit 1 bis 4 C-Atomen, einen Alkoxyrest mit 1 bis 4 C-Atomen, einen Alkylthioest mit 1 bis 4 C-Atomen oder Nitro und
- R' Wasserstoff, Halogen mit einer Atomnummer von 9 bis 35, einen Alkylrest mit 1 bis 4 C-Atomen, einen Alkoxyrest mit 1 bis 4 C-Atomen, einen Alkylthioest mit 1 bis 4 C-Atomen, $-\text{CF}_3$ in 3-Stellung des Ringes A, Nitro, $-\text{CN}$, $-\text{COOR}''$, einen gegebenenfalls substituierten Phenylrest der Formel $\text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{Y}^o$ oder einen gegebenenfalls substituierten Phenoxyrest in 4-Stellung des Ringes A der Formel $-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Y}^o$
- R'' Wasserstoff oder einen Alkylrest mit 1 bis 4 C-Atomen bedeuten,
- R und R' zusammen einen, ein oder zwei C-Atome enthaltenden, Alkylendioxyrest, welcher an zwei benachbarten C-Atomen des Phenylringes A substituiert ist und

Y_0 und Y unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen mit einer Atomnummer von 9 bis 35, einen Alkylrest mit 1 bis 4 C-Atomen oder einen Alkoxyrest mit 1 bis 4 C-Atomen bedeuten,

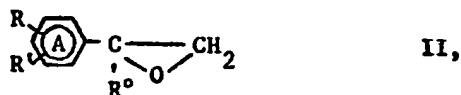
mit der Massgabe, falls R_0 für n-Butyl steht:

- a) wenigstens einer der Reste R und R' verschieden von Wasserstoff ist, und
- b) R oder R' nicht für Halogen stehen.

Halogenatome mit einer Atomnummer von 9 bis 35 sind Fluor, Chlor oder Brom.

Das Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I ist dadurch gekennzeichnet, dass man

- a) eine Verbindung der Formel

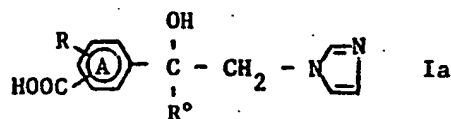


worin R^0 , R und R' die zuvor angegebenen Bedeutungen besitzen, mit einer Verbindung der Formel



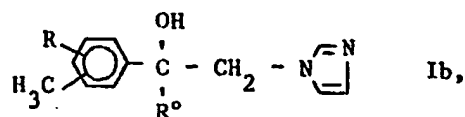
worin X ein Alkalimetallatom bedeutet, in einem organischen Lösungsmittel umgesetzt,

- b) um Verbindungen der Formel



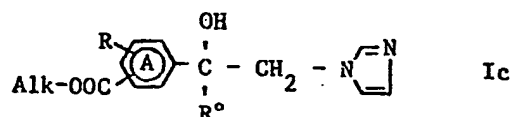
zu erhalten,

worin R^0 und R die zuvor genannten Bedeutungen besitzen, die CH_3 -Gruppe in einer Verbindung der Formel



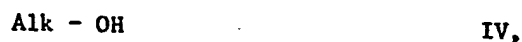
worin R° und R die zuvor genannten Bedeutungen besitzen, oxydiert oder

c) um eine Verbindung der Formel



zu erhalten,

worin R und R° die zuvor angegebenen Bedeutungen besitzen, eine Verbindung der Formel Ia mit einem Alkohol der Formel



oder einem funktionellen Derivat dieser Verbindung, worin Alk die angegebenen Bedeutungen besitzt, verestert.

Das Verfahren gemäss der Umsetzung a) kann bei Temperaturen von 0° bis 180°C , vorteilhaft zwischen 40° bis 120°C , in einem inerten organischen Lösungsmittel nach an sich bekannten Methoden durchgeführt werden, z.B. in einem Amid einer organischen Carbonsäure wie Dimethylformamid.

Die Verbindung der Formel III kann nach bekannten Methoden erhalten werden, vorteilhaft durch Umsetzen von Imidazol mit einer starken Base, wie einem Alkalimetallhydrid, z.B. Natriumhydrid, in einem organischen Lösungsmittel, welches vorteilhaft dasselbe Lösungsmittel ist, welches gemäss Verfahren a) verwendet wird.

Die Oxydation gemäss Verfahren b) kann mit Hilfe eines Oxydationsmittels durchgeführt werden, welches die Oxydation einer CH_3 -Gruppe zu einer COOH -Gruppe ermöglicht.

Geeignete Oxydationsmittel sind Kaliumpermanganat, Mangandioxyd und ähnliche Oxydationsmittel, vorteilhaft Kaliumpermanganat. Die Reaktion wird vorteilhaft in wässriger Lösung durchgeführt. Eine geeignete Reaktions-

temperatur für das Verfahren b) ist von 20° bis 150°C, vorteilhaft zwischen 60° bis 120°C.

Die Verbindungen der Formel Ia werden je nach Reaktionsbedingungen in Form der freien Säure oder in Salzform erhalten (ersetzen das H-Atom von -COOH durch ein Kation).

Die Säureform der Formel Ia kann in die entsprechenden Salzformen nach bekannten Methoden übergeführt werden und umgekehrt. Das Kation der Salzform einer Verbindung der Formel Ia ist vorteilhaft ein für die Landwirtschaft gebräuchliches und verträgliches annehmbares Kation, wie ein Na^+ , K^+ oder NH_4^+ -Kation.

Das Veresterungsverfahren c) kann nach an sich bekannten Methoden durchgeführt werden, mit solchen Verbindungen, welche eine funktionelle reaktive Hydroxylgruppe enthalten. Die Veresterung mit einem Alkohol einer Verbindung der Formel IV kann am geeignetsten durchgeführt werden bei Temperaturen von 30° bis 80°C, vorteilhaft unter wasserfreien Bedingungen und in Gegenwart einer Säure, z.B. Salzsäure. Geeignete Lösungsmittel für diese Reaktion sind organische Lösungsmittel oder ein Ueberschuss des Alkohols gemäss Formel IV.

Geeignete funktionelle Verbindungen der Alkohole von Formel IV sind die entsprechenden Diazoalkane, z.B. Diazoalkane mit 1 bis 3 C-Atomen oder ein Alkylhalogenid, insbesondere ein Chlorid, Bromid oder Jodid. Die Reaktion mit einem Diazoalkan kann nach an sich bekannten Methoden unter wasserfreien Bedingungen und in einem inerten organischen Lösungsmittel durchgeführt werden. Eine geeignete Reaktionstemperatur beträgt von -20° bis 40°C, gebräuchlicher -5° bis 20°C. Falls die Reaktion mit einem Alkylhalogenid durchgeführt wird, werden die Verbindungen der Formel Ia vorteilhaft in Salzform, z.B. als Alkalimetall oder Silbersalz eingesetzt. Eine solche Reaktion wird vorteilhaft in einem inerten organischen Lösungsmittel und bei Temperaturen von 0° bis 100°C, insbesondere bei 40° bis 90°C durchgeführt.

Die Reaktionsprodukte gemäss den Verfahren a), b) und c) können nach bekannten Methoden aus der Reaktionsmischung erhalten und nach bekannten Methoden aufgearbeitet und gereinigt werden.

Von den Verbindungen der Formel I, worin R' verschieden ist von -COOH, können die Salzformen hergestellt und verwendet werden.

Die Verbindungen der Formel I sind Aethanolderivate und können daher in freier Form oder in davon entsprechenden abgeleiteten Verbindungen, wie Aethanolat-Salzform vorkommen, z.B. in der Natriumäthanolatform und in einer Metallkomplexform, z.B. von Metallen der Gruppe Ib, IIa, IIb, VIb, VIIb und VIII des periodischen Systems, wie beispielsweise Kupfer und Zink, und mit Anionen, wie Chlorid, Sulfat, Nitrat, Carbonat, Acetat, Citrat, Dimethyldithiocarbonat, usw.

Alle Salze der Verbindungen der Formel I kommen vorteilhaft in einer für die Landwirtschaft verträglichen Salzform in Frage.

Die Säureadditionssalzformen, die Aethanolatsalzform und die Metallkomplexform können aus der entsprechenden freien Form nach bekannten Methoden durchgeführt werden und umgekehrt.

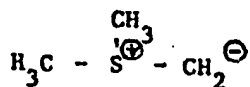
Die Verbindungen der Formel II können erhalten werden durch Umsetzen einer Verbindung der Formel



V,



worin R_0 , R, R' und R''' die zuvor genannten Bedeutungen besitzen, mit dem Reaktionsprodukt VI, hergestellt aus einer starken Base und Trimethylsulfoniumjodid, welches Reaktionsprodukt durch eine Verbindung der Formel



VI

dargestellt werden kann,

wobei diese Umsetzungen in einem inerten organischen Lösungsmittel durchgeführt werden.

00 11 00

3042303

Dieses Verfahren ist bekannt für die Herstellung von Epoxydverbindungen aus Ketonen.

Einige Verbindungen der Formel V sind bekannt und solche die als solche nicht bekannt sind, können aus bekannten Verbindungen analog den Verfahren, welche die Herstellung bekannter Verbindungen ermöglichen, hergestellt werden.

Viele Verbindungen der Formel II sind ebenfalls bekannt.

Die Verbindungen der Formel I sind als Fungicide geeignet zur Bekämpfung von phytopathogenen Fungi, besonders bei staubigen bzw. pulverartigen Mehltau, Schimmel oder Brand-Pilzen und bei Rost- bzw. Brand-Pilzen, wie im folgenden durch standartisierte in vivo und in vitro-Tests illustriert wird. Die Verwendung der Verbindungen der Formel I können bei Pflanzen, Samen oder im Boden nach bekannter Methode, wie sie bei fungiciden Verbindungen üblich ist, durchgeführt werden.

Es ist festzustellen bzw. festzuhalten, dass die Menge einer Verbindung der Formel I, welche eingesetzt wird, von verschiedenen bekannten Faktoren abhängig ist, wie z.B. von der verwendeten Verbindung als solche, ob die Behandlung prophylaktisch oder therapeutisch durchgeführt wird, ob die Verbindung als Spray in einem Blattwerk, als Behandlung im Boden oder als Saatgut- oder Samen-Behandlung bzw. -Ueberzug, die Behandlung bzw. Behandlungsart der Gattung bzw. Species, der Fungi und die Anwendungszeit.

Im allgemeinen werden befriedigende Resultate erhalten, wenn die Verbindung beim Bepflanzungsort, entweder bei den Pflanzen oder im Boden in einer Menge von ungefähr 0,01 bis 5, vorteilhaft von ungefähr 0,01 bis 2 kg/Hektare Aktivsubstanz bzw. Aktivbestandteil eingesetzt wird. Die Behandlung kann gewünschtenfalls wiederholt werden, z.B. in einem 5- bis 30-tägigen Intervall. Wenn die Verbindung bei einer Samenbehandlung eingesetzt wird, erhält man befriedigende Resultate, wenn die Verbindung in einer Menge von ungefähr 0,05 bis 0,5, vorteilhaft von ungefähr 0,1 bis 0,3 g/kg Samen eingesetzt wird.

Der Ausdruck "soil" in der Bedeutung von Boden, Suhle usw. umfasst jedes Wachstumsmedium, d.h. Bodenart, sei es natürlich oder künstlich.

Die Erfindung umfasst als zusätzlichen Gegenstand fungicide Zusammensetzungen, enthaltend als Fungicid eine Verbindung der Formel I in freier Form oder in einer für die Landwirtschaft geeigneten Salzform und einem inerten fungiciden Carrier oder Lösungsmittel. Im allgemeinen enthalten die Zusammensetzungen von ungefähr 0,01 bis 90, vorteilhaft von ungefähr 0,1 bis 60 Gewichtsprozent, an Aktivsubstanz.

Die Zusammensetzungen können in konzentrierter Form sein, welche man vor der Anwendung verdünnt oder in verdünnter Form, welche direkt verwendet werden kann.

Beispiele von bevorzugten Formen sind benetzbare Pulver, Emulsionskonzentrationen, Staubformen, Sprühformen, Granulate und Formen, in denen die Aktivsubstanz mit Verzug freigelassen wird, Formen, in denen die üblichen Carrier und andere Verdünner und/oder andere Hilfsmittel eingebaut werden, welche in der Landwirtschaft gebräuchlich bzw. geeignet sind.

Anwendungsformen von solchen Zusammensetzungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 10 Gewichtsprozent einer Verbindung der Formel I als Aktivsubstanz. Konzentrierte Formen von Zusammensetzungen für den fungiciden Einsatz enthalten im allgemeinen ungefähr zwischen 2 und 80, vorteilhaft ungefähr zwischen 5 und 70, Gewichtsprozent einer Verbindung der Formel I als Aktivstoff.

Formen von Emulsionskonzentrationen enthalten ungefähr zwischen 10 bis 70; vorteilhaft von ungefähr 20 bis 60 Gewichtsprozent an Aktiv-Beistandteil. Bevorzugt sind feste Zusammensetzungen.

Die Zusammensetzungen, welche insbesondere für Sprays zubereitet werden, enthalten vorteilhaft ein oberflächenaktives Hilfsmittel, wie einen flüssigen Polyglykoläther, ein fettartiges Alkylsulfat oder ein Ligninsulfonat.

Zusätzlich zu den üblichen Carriern und oberflächenaktiven Hilfsmitteln können die erfindungsgemässen Formulierungen, welche eine Verbindung der Formel I enthalten, weitere zusätzliche Hilfsmittel mit speziellen Eigenschaften für spezielle Zwecke enthalten, z.B. Stabilisatoren, Desaktivatoren (für feste Formulierungen an Carriern mit einer oberflächenaktiven Verbindung gebunden), Wirkstoffe oder Hilfsmittel um das Anhaften an Pflanzen zu verbessern, Korrosionsinhibitoren, Anti-Schaummittel und Farbstoffe. Ausserdem können weitere Fungicide, Bakterizide oder andere, die Wirkung begünstigende Aktivstoffe, wie z.B. Insektizide, den Formulierungen beigelegt werden und sind weitere Darstellungen der Erfindung zu betrachten.

Beispiele für die Darstellung von fungiciden Formulierungen werden im folgenden beschrieben:

a) Benetzbare Pulverformulierung

50 Teile einer Verbindung der Formel I, z.B. α -tert.-Butyl- α -(para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol werden mit 2 Teilen Laurylsulfat, 3 Teilen Natriumligninsulfonat und 45 Teilen fein verteiltes Kaolinit so lange gemahlen, bis die mittlere Teilchengrösse unter 5 Mikrons ist. Das so erhaltene benetzbare Pulver wird vor dem Gebrauch in Wasser gelöst, bzw. in Wasser verdünnt, bis zu einer Konzentration von 0,01 - 5% an Aktivsubstanz. Die erhaltene Sprayflüssigkeit kann als Spray für das Blätterwerk als auch zur Durchtränkung bei den Wurzeln bzw. als Wurzelspray eingesetzt werden.

b) Granulat-Formulierung

Auf 94,5 Gewichtsteile Quarzsand in einem Trommelmischer werden 0,5 Gewichtsteile eines Bindemittels (ein nichtionisches Tensid) aufgesprüht und das Ganze tüchtig gemischt. 5 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel I, z.B. pulveriges α -tert.-Butyl- α -(para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol werden hierauf zugegeben und kräftig gemischt, um eine Granulat-Formulierung zu erhalten mit einem Teilchenbereich von 0,3 bis 0,7 mm. Das Granulat kann dem Boden beige-

menget werden, indem die Pflanzen behandelt bzw. aufgezogen werden sollen.

c) Emulsionskonzentration

25 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel I, z.B. α -tert.-Butyl- α -(para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol werden mit 30 Gewichtsteilen Iso-octylphenyl-octagelykoläther und 45 Gewichtsteilen einer Petroleumfraktion mit einem Siedepunktbereich von 210-280°C (D_{20} : 0,92) gemischt. Dieses Konzentrat kann mit Wasser bis zur gewünschten Konzentration verdünnt werden.

d) Samen-Ueberzug bzw. Samen-Behandlung

45 Teile einer Verbindung der Formel I, z.B. α -tert.-Butyl- α -(para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol werden mit 1,5 Teilen eines Äthylenoxydanlagerungsproduktes von Diamylphenol-decaglykoläther, 2 Teilen Spindelöl, 51 Teilen fein gemahlener Talk und 0,5 Teilen Rhodamin B gemischt. Die Mischung wird in einer Contraplex-Mühle bei 10'000 rpm gemahlen, bis die durchschnittliche Teilchengrösse kleiner als 20 Mikrons erreicht ist. Das so erhaltene trockene Pulver um das Saatgut zu behandeln besitzt gute Haftbarkeit und kann Samen bzw. dem Saatgut beigefügt werden, z. B. durch Mischen während 2 bis 5 Minuten in einem sich langsam drehenden Kessel.

Die Verbindungen der Formel I können gegen die nachstehend aufgeführten Fungi eingesetzt werden, d.h. scheinen gegenüber diesen von besonderem Interesse zu sein:

A) Basidiomycetes, enthaltend

- A₁) solche der Gattung Uredinales, wie diejenigen der Art Uromyces bei Pflanzen, wie bei Bohnen, z.B. Uromyces appendiculatus, und bei Zierpflanzen, z.B. Uromyces dianthi, diejenigen der Art Hemileia bei Pflanzen, wie beim Kaffee, z.B. Hemileia vastatrix, diejenigen der Art Puccinia in Pflanzen wie beim Getreide (z.B.

05.11.80

3042303

- 14 -

Case 136-6877

Weizen, Hafer, Gerste), z.B. Puccinia graminis, Puccinia recondita und Puccinia striiformis, oder bei Zierpflanzen, z.B. Puccinia pelargonizonalis und Puccinia antirrhini, diejenigen der Art Phakopsora in den Pflanzen wie Soja, z.B. Phakopsora pachyrhizi, diejenigen der Art Melampsora in Pflanzen wie Flachs, z.B. Melampsora lini und diejenigen der Art Tranzschelia, z.B. Tranzschelia pruni in Pflaumen;

A₂) diejenigen der Gattung Ustilaginales wie diejenigen der Art Ustilago bei Pflanzen wie Gerste, Weizen, Korn und Zuckerrohr, z.B. Ustilago maydis beim Korn und Ustilago unda bei der Gerste, und

A₃) diejenigen der Gattung Stereum bei Bäumen von Kern- und Steinfrüchten, z.B. Stereum purpureum bei Äpfeln und Pflaumen.

B) Ascomycetes, enthaltend

B₁) diejenigen der Gattung Erysiphales wie diejenigen der Art Erysiphe bei Pflanzen, wie Gurke, Gerste, Weizen und Rübenzucker, z.B. Erysiphe graminis f. sp. tritici beim Weizen und Erysiphe cichoracearum bei den Gurken; diejenigen der Art Spohaerotheca bei den Gurken und Rosen, z.B. Spohaerotheca pannosa bei den Rosen; diejenigen der Art Podosphaera bei den Äpfeln, Birnen und Pflaumen, z.B. Podosphaera leucotricha bei den Äpfeln; diejenigen bei der Art Uncinula bei den Pflanzen wie Weinbeeren, z.B. Uncinula necator bei Weintrauben; diejenigen der Art Oidium bei einer grossen Anzahl von Pflanzen und diejenigen der Art Leveillula bei Pflanzen wie Baumwolle und andern Malvaceae, z.B. Leveillula taurica bei der Baumwolle.

C) Oomycetes, enthaltend

C₁) diejenigen der Art Phytophthora spp., z.B. Ph. cactorum, Ph. parasitica und Ph. cinamomi bei empfindlichen Pflanzen; und

130035/0359

C₂) diejenigen der Art Aphanomyces bei Pflanzen wie der Erbse und Zuckerrübe, z.B. Aphanomyces euteiches bei der Zuckerrübe, und

D) Deuteromycetes, enthaltend

D₁) diejenigen der Art Helminthosporium bei Pflanzen wie Gerste und Korn, z.B. Helm. Sativum;

D₂) diejenigen der Art Septoria bei Pflanzen wie Weizen, Tomaten und Sellerie, z.B. Sept. tritici bei Weizen, Tomaten und Sellerie, z.B. Sept. tritici in Weizen;

D₃) diejenigen der Art Rhizoctonia bei Pflanzen wie bei der Baumwolle und Kartoffel, z.B. Rhiz. solani bei der Baumwolle;

D₄) diejenigen der Art Fusarium spp. z.B. F. oxysporum f. sp. lycopersici bei der Tomate, F. oxysporum f. sp. vasinfectum bei der Baumwolle, F. oxysporum f. sp. cubense bei der Banane, F. solani bei Gemüse, F. culmorum bei den Getreidearten und F. graminearum bei den Getreidearten;

D₅) diejenigen der Art Thielaviopsis bei Pflanzen wie bei der Baumwolle, Tabak usw., z.B. Thielaviopsis basicola bei der Baumwolle;

D₆) diejenigen bei der Art Phoma bei Pflanzen wie Zuckerrübe, Raps usw., z.B. Phoma betae bei Zuckerrüben;

D₇) diejenigen der Art Piricularia spp., z.B. P. oryzae beim Reis und

D₈) diejenigen der Art Colletotrichum spp. z.B. C. lindemuthianum bei den Bohnen.

Die folgenden allgemein üblichen Tests illustrieren die Möglichkeiten, in denen die fungicide Aktivität der Verbindungen der Formel I festgestellt bzw. festgelegt werden kann.

00-1180

3042303

- 16 -

Case 136-6877

Test-Methode A

In Vivo-Test unter Verwendung des Bohnen-Rostpilzes (Uromyces appendiculatus). Phaseolus vulgaris (Stangenbohnen) wird in einem Gemisch aus Torf und Sand oder Erde in Plastik-Töpfen von 9 cm Durchmesser während 9 Tagen gezüchtet. Die Pflanzen werden mit einer Spraylösung besprüht, welche 0,0008 bis 0,05% (d.h. mit einer 0,0008%, 0,003%, 0,012% und 0,05%igen Lösung) an Aktivstoff enthält. Die Behandlung umfasst eine Blattbesprühung von aufgelaufenen, d.h. ausgetriebenen Blättern oder eine Bodenbehandlung, d.h. eine Bodenbenässung (28 ml Sprayflüssigkeit pro Topf). Nach dem Trocknen werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension inoculiert, enthaltend 500'000 bis 700'000 Sporen/ml und während 7 Tagen inkubiert in einem Incubationsraum bei 21°C und 100%iger relativer Feuchtigkeit. Die Wirksamkeit der Behandlung mit dem Aktivstoff wird festgestellt durch Vergleichen der Anzahl der Pusteln oder Pickel pro Blatt mit einem solchen Vergleichsblatt, das nicht mit dem Aktivstoff behandelt, aber auf dieselbe Art inoculiert wurde. Die Verbindungen der Formel I, insbesondere die Verbindungen, wie sie hierin in den Beispielen aufgeführt sind, z.B. die Verbindungen der Beispiele 1, 2A, 2 Z-2 und 2 Z-11 in Form einer wie zuvor angegebenen benetzbaren Pulverformulierung eingesetzt, ergeben ein signifikantes Mass an fungicider Aktivität gemäss dem oben aufgeführten Test und zwar sowohl bei der Behandlung durch direkten Kontakt als auch bei der Behandlung bei der Wurzel. Analoge Tests können an folgenden Nutzpflanzen/Fungi mit ähnlich guten Resultaten durchgeführt werden.

- Kaffee: Kaffeeblattrostpilz (Hemileia vastatrix)
Weizen: schwarzer Stengelpilz (Puccinia graminis)
Weizen: brauner Blattrostpilz (Puccinia recondita)
Weizen: gelber oder streifiger Rostpilz (Puccinia striiformis)
Flachs: Flachsrostpilz (Melampsora Lini)
Pelargonie: Pelargonie-Rostpilz (Puccinia pelargonizionalis)
Löwenmaul: Löwenmaul-Rostpilz (Puccinia antirrhini)

130035/0359

Test-Methode B

In Vivo-Test unter Verwendung des pulverartigen Gurken-Meltau (Erysiphe cichoracearum) Cucumis sativus (Gurke) wird in einem Gemisch aus Torf und Sand oder Erde in Plastik-Töpfen von 6 cm Durchmesser während 7 Tagen gezüchtet. Die Pflanzen werden mit einer Spraylösung besprüht, welche 0,0008 bis 0,05% (d.h. mit einer 0,0008%, 0,003%, 0,012% und 0,05%-igen Lösung) an Aktivstoff enthält. Die Behandlung umfasst eine Blattbesprühung von aufgelaufenen, d.h. ausgetriebenen Blättern oder eine Bodenbehandlung, d.h. eine Bodenbenässung (28 ml Sprayflüssigkeit pro Topf). Nach dem Trocknen werden die Pflanzen mit einer frisch gesammelten conidia durch Bestäuben inoculiert und hierauf während 7 Tagen in einem Incubationsraum bei 25° bis 30°C und einer 60-80%igen relativen Feuchtigkeit incubiert. Die Wirksamkeit der Behandlung mit dem Aktivstoff wird festgestellt durch Vergleichen des Grades des fungiciden Befalles mit einem solchen Vergleichsbefall, der nicht mit dem Aktivstoff behandelt, aber auf dieselbe Art und Weise inoculiert wurde. Die Verbindungen der Formel I, insbesondere die Verbindungen wie sie hierin in den Beispielen aufgeführt sind, z.B. die Verbindungen der Beispiele 1, 2A, 2C, 2D, 2G, 2J, 2Q, 2T, 2 Z-1, 2 Z-2, 2 Z-5, 2 Z-6, 2 Z-7, 2 Z-9, 2 Z-11 und 2 Z-12 in Form einer wie zuvor angegebenen benetzbaren Pulverformulierung eingesetzt, ergeben einen signifikanten Grad (Wert) an fungicider Aktivität gemäss dem oben genannten Test und zwar sowohl bei der Behandlung durch Kontakt als auch bei der Behandlung bei der Wurzel. Analoge Tests gemäss der Testmethode B können an folgenden Nutzpflanzen/Fungi mit ähnlich guten Resultaten durchgeführt werden.

Weizen: pulverartiger Weizenmeltau (Erys. gram. f. sp. tritici)
Gerste: pulverartiger Gerstenmeltau (Erys. gram. f. sp. hordei)
Apfel: pulverartiger Apfelmeltau (Podos. leucotricha)
Weinbeere: pulverartiger Weinrebenmeltau (Uncinula necator)

Hinsichtlich des pulverartigen Gurkenmeltaus kann die oben genannte Test-Methode B mit der bevorzugten Verbindung von Beispiel 1 wiederholt werden (sowohl die Blattbesprühung als auch die Bodenbehandlung); wobei

00-11-80

3042303

- 18 -

Case 136-6877

aber der Test mit niedrigeren Konzentrationen von 0,0002% und 0,00005% durchgeführt wird, mit dem Ergebnis, dass noch eine 100%ige bzw. 80%ige Beschränkung der Fungi durch Besprühen erreicht wird; eine 55%ige bzw. 10%ige Beschränkung durch Bodenbehandlung zeigt die hervorragende Wirksamkeit der Erfindung.

Test-Methode C

In vitro unter Verwendung von Ustilago maydis (Getreidebrand). Verschiedene Konzentrationen von Aktivstoff werden in Malzagarplatten eingegeben, um Konzentrationen von 0,8 bis 200 ppm a.i. (z.B. von 0,8, 3,2, 12,5, 50 und 200 ppm) zu erhalten. Die Platten werden dazu durch Besprühen einer Sporensuspension von U. maydis inoculiert oder durch Einsetzen eines Agarpfropfens, welcher die Fungi enthält, in die Mitte der Platte. Die Platten werden bei Raumtemperatur während 2 bis 5 Tagen incubiert. Die Wirksamkeit der Behandlung mit dem Aktivstoff wird festgestellt durch Vergleichen des Wachstums des Fungus mit solchen Fungi auf Vergleichsplatten, die nicht mit dem Aktivstoff behandelt, aber auf ähnliche Weise inoculiert wurden. Die Verbindungen der Formel I ergeben eine mässige bis gute Beschränkung gemäss der Test-Methode C.

Die Verbindungen von Beispiel 1, 2C und 2 Z-8, wie sie später aufgeführt werden, ergeben z.B. eine gute Beschränkung bei der höheren Konzentration gemäss der Test-Methode C. In einem analogen Test an Fusarium oxysporum f. sp. ergibt die Verbindung von Beispiel 1 bei niedriger und höherer Konzentrationen eine gute Beschränkung.

Fungi der zuvor genannten Gattungen ergeben in der Landwirtschaft einen beträchtlichen Schaden und sind schwierig zu bekämpfen oder zu verhüten, bzw. abzuhalten.

Um solche Fungi zu bekämpfen, erscheinen die Verbindungen der Formel I bei den wirksamen Mengen nicht phytotoxisch zu sein bei den Pflanzen und es ist deshalb angezeigt, dass sie von besonderem Interesse sind, um die Fungi durch gezielte Aktion zu bekämpfen, z.B. bei der Bekämpfung von Uromyces appendiculatus bei Bohnen.

130035/0359

Analoge zusätzliche Tests zur Test-Methode C bei 13, 50 und 200 ppm a.i. zeigen, Ausnahmen werden speziell bezeichnet, eine 100%ige Beschränkung mit der Verbindung von Beispiel 1 bei wenigstens einer Test-Dosierung bei den folgenden Pflanzen:

Phytophthora cactorum (maximale Beschränkung 85%); Phytophthora cinamomi (maximale Beschränkung 65%); Aphanomyces euteiches; Stereum purpureum; Thielaviopsis basicola (maximale Beschränkung 80%); Piricularia oryzae (maximale Beschränkung 70%) und Colletotrichum lindemuthianum (maximale Beschränkung 65%).

Zusätzliche Tests analog den Test-Methoden A und B mit Mengen von 32, 125 und 500 ppm a.i., durchgeführt mit der Verbindung von Beispiel 1 zeigen bei der Besprühungs-Anwendung eine 60%ige, 80%ige bzw. 90%ige Beschränkung von Helminthosporium ohne Phytotoxizität.

Test-Methode D

In vivo, unter Verwendung von Rhizoctonia solani. Der Fungus wird in einer sterilen Mischung aus Zonolit und Kornmehl (10:1 w/w) gezüchtet, zu welcher Wasser im Verhältnis ungefähr 1:1 (w/w) zugegeben wird; das Wachstum dauert 14 Tage bei 25°C. Der Fungus wird dann in eine praktisch sterile Mischung von Torf und Sand gemischt, welche hierauf mit einer Suspension behandelt wird, welche den formulierten Aktivstoff enthält, in einer Konzentration von 10 bis 160 ppm (z.B. 10, 40 und 160 ppm), berechnet auf das Volumen des Substrates. Das Substrat wird dann in Töpfe mit einem Durchmesser von 5 cm gegeben, welche mit Baumwollsämlingen (cotyledonous stage) bepflanzt wurden. Die bepflanzen Töpfe werden bei 24°C und bei 60-70%iger relativer Feuchtigkeit in einem Inkubationsraum während 14 Tagen incubiert. Nach dieser Zeit kann ein krankhafter Befall festgestellt werden beim Vergleich des fungiciden Befalls an den Wurzeln und des Hypocotyl mit solchen unbehandelten und ähnlich inoculierten Vergleichspflanzen. Die Verbindungen von Beispiel 1, wie sie in der angegebenen benetzbaren Pulverformulierung eingesetzt werden, verursachen z.B. eine 100%ige krankhafte Beschränkung ohne Phytotoxizität bei der niedrigeren Dosierung.

08-11-50

3042303

- 20 -

Case 136-6877

Ein Test analog zur Test-Methode D unter Verwendung von Phoma betae bei der Zuckerrübe ergibt eine 100%ige Beschränkung mit etwa 20% Phytotoxizität bei der niedrigen Dosierung.

Aus den zuvor genannten Angaben geht hervor, dass die Verbindungen der Erfindung für den Fachmann von solcher Bedeutung sind, dass sie insbesondere von Interesse sind hinsichtlich der Ueberwachung und Beschränkung von Boden- und Saatgutpilzen, z.B. Helminthosporium, Phoma, Rhizoctonia und Thielaviopsis, und zusätzlich ihres bedeutenden Interesses und Wertes bei der Beschränkung und Bekämpfung von pulverartigen Mehltau- und Rostpilzen.

Der besondere Wert und die besonderen Vorteile der Erfindung werden bestätigt und/oder weiter dargelegt in genaueren Wertbestimmungen bei der Verbindung des nachfolgenden Beispiels 1, welches die folgenden hervorragenden und in manchen Fällen bemerkenswerten Eigenschaften aufweist:

- 1) eine stetige Behandlung bei Stangenbohnen mit Spraykonzentrationen von 0,012% 8 Tage vor der Inoculierung bewirkt eine 70 %ige Beschränkung von Uromyces app.;
- 2) eine gute Beständigkeit der wässerigen Suspensionen bei der 100 %igen Beschränkung von Uromyces app. bei Stangenbohnen auch noch 3 Tage nach der Bereitung der Suspension mit einer 0,012%igen Konzentration;
- 3) schnelles und andauerndes Eindringen der Aktivsubstanz in die Blätter hinein, wobei wie oben dargelegt, eine 80%ige Beschränkung bei einer Konzentration von 0,012% gesichert ist, nach dem Waschen der Blätter der Weinbeere während 15 Minuten zwei Stunden nach der Anwendung der Aktivsubstanz und gefolgt von Befall durch Uncinula;
- 4) eine 65%ige Beschränkung beim Beregnen der Blätter von Kaffeepflanzen mit einer Regenmenge von 50 MM/Stunde zwei Stunden nach dem Aufgeben der Aktivsubstanz während 15 Minuten, gefolgt von einer Trockenphase und einer zweiten Regenphase während 15 Minuten, gefolgt von einem Befall der Kaffeepflanze durch Hemileia vastatrix und



130035/0359

- 5) eine 60%ige Beschränkung bei einer simulierten Regenwaschung der Blätter von Stangenbohnen bei einer Regenmenge von 50 MM/Stunde zwei Stunden nach der Anwendung der Aktivsubstanz während 10 Minuten, gefolgt durch den Befall der Stangenbohnen durch Uromyces app. .

Ein weiterer Vorteil der Verbindung des nachfolgenden Beispiels 1 ist eine 100%ige fungicide Aktivität, welche erreicht wird bei der Behandlung mit der Aktivsubstanz und einer Konzentration von 0,012% einen Tag nachdem die Stangenbohnen mit Uromyces app. befallen wurden und eine 60%ige Beschränkung zwei Tage nach dem Befall.


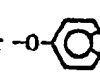
Andere Verbindungen der Formel I gemäss Beispiel 2 zeigen sehr gute bis hervorragende fungicide Aktivität, wenn sie nach den zuvor beschriebenen Verfahren eingesetzt, bzw. geprüft werden.

Bevorzugte Verbindungen der Formel I haben eine oder mehrere und vorteilhafte alle folgende Massnahmen:

- a) R^o steht für einen Alkylrest mit 3 bis 6 C-Atomen, für Cycloalkyl mit 3 bis 6 C-Atomen oder für Cycloalkylmethyl, in welchem der Cycloalkylteil 3 bis 6 C-Atome aufweist;
- b) R steht für Wasserstoff, Halogen mit einer Atomnummer von 9 bis 35 oder für (1-4C)-Alkyl;
- c) R' steht für Wasserstoff, Halogen mit einer Atomnummer von 9 bis 35, für (1-4C)-Alkyl, (1-4C)-Alkoxy oder (1-4C)-Alkylthio oder
- d) R'' steht für eine der Gruppen  oder  in para-Stellung im Ring A gebunden.

Die besonders bevorzugten Verbindungen der Formel I haben eine oder mehrere und vorteilhaft alle der folgenden Massnahmen:

- a) R_o steht für einen Alkylrest mit 3 bis 5 C-Atomen oder für Cycloalkyl mit 3 bis 6 C-Atomen;
- b) R steht für Wasserstoff, Fluor oder Chlor und
- c) R' steht für Wasserstoff, Halogen mit einer Atomnummer von 9 bis 35, (1-2C)-Alkyl oder (1-2C)-Alkoxy oder

d) R steht für Wasserstoff und R' für einen Rest  oder , gebunden in para-Stellung von Ring A, vorzugsweise stehen Y₀ und Y für Wasserstoff.

Im allgemeinen steht R₀ vorteilhaft für Propyl oder für verzweigtes Butyl, z.B. n-Propyl, Isopropyl, sec.-Butyl, Isobutyl oder tert.-Butyl oder Cyclopropyl oder Cyclopentyl, aber ganz besonders ist R₀ tert.-Butyl.

Im allgemeinen sind solche Verbindungen bevorzugt, in denen wenigstens R oder R' verschieden von Wasserstoff sind, insbesondere für einen Alkylrest steht, z.B. für Methyl oder Äthyl oder Phenyl in para-Stellung im Ring A, wobei der andere Rest für Wasserstoff oder Halogen steht.

Die folgenden Beispiele sollen die Erfindung illustrieren. Alle Temperaturen sind in Celsiusgraden angegeben.

Beispiel 1

α-tert.-Butyl-α-(para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol

Eine 0,82g Portion von 61,4%igem Natriumhydrid wird drei Mal mit Petroläther gewaschen und dann unter Rühren zu 10 ml Dimethylformamid zugegeben. Zur so erhaltenen Suspension werden unter Rühren langsam 1,43g Imidazol, gelöst in 10 ml Dimethylformamid, gegeben, wobei unter Erwärmen Blasen entstehen. Man erhitzt die erhaltene Mischung auf 40° unter Rühren während 30 Minuten bis die Blasenbildung beendet ist, worauf 4,0g 2-tert.-Butyl-2-(4-methylphenyl)-oxiran zugegeben werden; das gesamte Gemisch wird 1 1/2 Stunden bei 70° erwärmt. Das erhaltene Gemisch wird alsdann auf Wasser gegossen und das wässrige Gemisch mit Äthylacetat extrahiert, die organische Phase mit Wasser gewaschen, getrocknet und evakuiert, wobei ein Öl zurückbleibt, welches auf Raumtemperatur abgekühlt wird; dabei erhält man einen festen Anteil, der aus einem Gemisch aus Hexan/Tetrachlormethyl umkristallisiert wird (10:90), wobei mit dem α-tert.-Butyl-α-(para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol mit einem Schmelzpunkt von 135-137° erhalten wird.

Beispiel 2

Verfährt man nach den Angaben gemäss Beispiel 1, so erhält man die nachstehenden erfindungsgemässen Verbindungen:

- A) α -n-Butyl- α -(para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 136-138°.
- B) α -tert.-Butyl- α -(para-chlorphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol.
- C) α -tert.-Butyl- α -(ortho, para-dichlorphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 141-142°.
- D) α -tert.-Butyl- α -phenyl-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 124-125°.
- E) α -n-Propyl- α -(para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 156-157°.
- F) α -tert.-Butyl- α -(para-fluorphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol.
- G) α -tert.-Butyl- α -(para-methoxyphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 153-155°.
- H) α -tert.-Butyl- α -(meta-nitrophenyl)-1H-imidazol-1-äthanol.
- I) α -tert.-Butyl- α -(meta-trifluormethylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol.
- J) α -tert.-Butyl- α -(meta-cyanphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 156-157°.
- K) α -tert.-Butyl- α -(meta, para-methylenedioxyphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol.
- L) α -tert.-Butyl- α -(para-biphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 174-175°.
- M) α -tert.-Butyl- α -(para-phenoxyphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol.
- N) α -iso-Propyl- α -(para-chlorphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol.
- O) α -tert.-Butyl- α -(meta, para-dichlorphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol.
- P) α -iso-Butyl- α -(para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol.
- Q) α -n-Propyl- α -phenyl-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 119-120°.
- R) α -Aethyl- α -(para-chlorphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 167-168°.
- S) α -Neopentyl- α -phenyl-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 169-170°.
- T) α -Cyclopropyl- α -(para-chlorphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 132-134°.
- U) α -n-Pentyl- α -phenyl-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 146-147°.
- V) α -Cyclopropyl- α -(para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol.

- W) α -Cyclopentyl- α -(para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol.
- X) α -tert.-Butyl- α -(para-methylthiophenyl)-1H-imidazol-1-äthanol.
- Y) α -sec.-Butyl- α -(para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol.
- Z) α -iso-Butyl- α -(para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol.
- Z-1) α -tert.-Butyl- α -(meta-bromo-para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 139-142°.
- Z-2) α -tert.-Butyl- α -(meta-fluor-para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 150-152°.
- Z-3) α -tert.-Butyl- α -(meta-chlor-para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 152-156°.
- Z-4) α -tert.-Butyl- α -(meta-chlor-meta-methoxyphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol.
- Z-5) α -n-Butyl- α -phenyl-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 138-139°.
- Z-6) α -Cyclopentyl- α -phenyl-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 144-145°.
- Z-7) α -Isopentyl- α -phenyl-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 169-170°.
- Z-8) α -n-Butyl- α -(ortho, para-dichlorphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol.
- Z-9) α -tert.-Butyl- α -(meta-meta-dichlorphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 159-161°.
- Z-10) α -tert.-Butyl- α -(meta, para-dimethylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 145-146°.
- Z-11) α -tert.-Butyl- α -(para-Aethylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 115-118°.
- Z-12) α -tert.-Butyl- α -(meta-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 90-92°.
- Z-13) α -tert.-Butyl- α -(para-tert.-Butylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 155-157°.
- Z-14) α -tert.-Butyl- α -(para-methoxyphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 153-155°.
- Z-15) α -tert.-Butyl- α -(meta-methoxyphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 114-115°.
- Z-16) α -tert.-Butyl- α -(para-cyanphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol, Smp. 143-145°.

Z-17) α -Isopentyl- α -(para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol,

Smp. 104-105°.

Z-18) α -(1-Methylbutyl)- α -(para-methylphenyl)-1H-imidazol-1-äthanol,

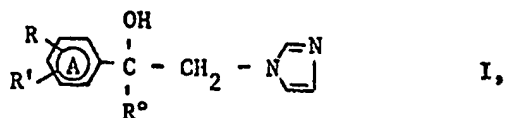
Smp. 119-122°.

B e i s p i e l 3

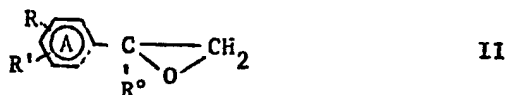
Eine 2,2g Portion von 61,4%igem Natriumhydrid wird 3 Mal mit Petrol-äther gewaschen, mit 70 ml Dimethylsulfoxid versetzt und das Gemisch unter Rühren auf 70° erwärmt und die Reaktion unter Erwärmung bis zu 85° durchgeführt, worauf das Gemisch bei 75° während 40 Minuten erwärmt wird. Die erhaltene Mischung wird in einem Eis-Salz-Bad auf 0° abgekühlt und unter Stickstoffstrom eine Lösung, bestehend aus 7,0g von Trimethylsulfoniumjodid, 50 ml Dimethylsulfoxid und 20 ml Tetrahydrofuran, tropfenweise zugegeben, während die Temperatur unter 18° aufrecht erhalten wird. Zur so erhaltenen Mischung werden alsdann unter Rühren eine Lösung, bestehend aus 3,0g tert.-Butyl-para-methylphenyl-keton in 30 ml Tetrahydrofuran beigefügt, während die Temperatur unter 10° gehalten wird. Das erhaltene Reaktionsgemisch wird alsdann bei 0° während 30 Minuten weitergerührt und hierauf bei Raumtemperatur während 2 Stunden. Die Mischung wird dann auf 400 ml Wasser geschüttet, mit Methylenchlorid, die organische Phase mit Wasser und alsdann mit Sole gewaschen, getrocknet und evakuiert, um ein gelbliches Öl der Verbindung 2-(tert.-Butyl)-2-(4-methylphenyl)-oxiran zu erhalten.

Z u s a m m e n f a s s u n g

Verbindungen mit fungiciden Eigenschaften, Zusammensetzungen von solchen Verbindungen, um die Bekämpfung von Fungi in der Landwirtschaft einfacher durchzuführen, Verfahren zur Bekämpfung von Fungi; sowie ein Mittel zur Durchführung des Verfahrens enthaltend diese Verbindungen als Aktivstoff; die Verbindungen entsprechen der Formel



worin R, R', R° und A, die im Anspruch angegebenen Bedeutungen besitzen; die Verbindungen können erhalten werden, indem man eine Verbindung der Formel



mit einer Verbindung der Formel



worin X ein Alkalimetallatom bedeutet, in einem inerten organischen Lösungsmittel umgesetzt.

3700/ZC/CH

30.10.1980

130035/0359